

(19) HU

MAGYAR
NÉPKÖZTÁRSASÁG



ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

B

(11)

192991

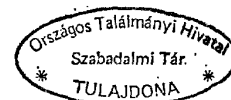
Bejelentés napja: (22) 1984.08.17. (21) (3130/84)

Elsőbbsége: (32) 1983.08.19.
(31) (4535/83-8)
(33) Svájc

Közzététel napja: (41) (42) 1985.07.29.

Megjelent: (45) 1988.12.12.

Nemzetközi
osztályozás:
(51) NSZO:
C 07 D 239/62
C 07 D 401/12
A 61 K 31/515



Feltalálók: (72)

dr. Burckhardt Urs, Basel,
dr. Gallay Jean Jacques, Magden,
dr. Kühne Manfred, Pfeffingen,
Svájc

Szabadalmas: (73)

Ciba-Geigy Ag., Basel,
Svájc

(54) ELJÁRÁS BARBITURSAV-SZÁRMAZÉKOK ÉS EZEKET A VEGYÜLETEKET TARTALMAZÓ ANTHELMINTIKUS KÉSZÍTMÉNYEK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

1

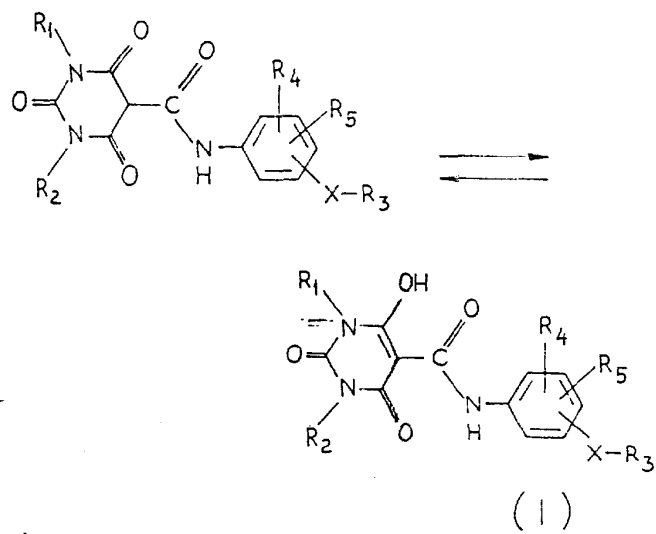
2

(57) KIVONAT

A találmány tárgya eljárás (I) általános képletű 5-fenil-karbamoil-barbitursav-származékok, tautomerjeik és sóik előállítására, e képletben

R_1 és R_2 egymástól függetlenül 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxics csoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport vagy allilcsoport;
 R_3 helyettesítetlen naftil-, fenil- vagy piridilcsoport vagy egyezéresen benzilcsoporttal, vagy egyezéresen, kétszeresen vagy háromszorosan halogénatommal, cianocsoporttal, 1-5 szénatomos alkilcsoporttal, trihalogén-metil-csoporttal, dihalogén-metoxi-csoporttal vagy 1-5 szénatomos alkoxics csoporttal helyettesített fenil- vagy piridilcsoport;
 R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, trihalogén-me-

til-csoport, 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-5 szénatomos alkoxics csoport vagy 1-5 szénatomos alkil-tio-csoport, és oxigén- vagy kénatom, azzal a megszorítással, hogy
- R_1 1-3 szénatomos alkoxics csoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport vagy allilcsoport, akkor, ha R_2 valamely 1-5 szénatomos alkilcsoport, R_3 trihalogén-metil-csoporttal egyezéresen, kétszeresen vagy háromszorosan helyettesített fenilcsoport, továbbá R_4 és R_5 szubsztituensek mindegyike egyidejűleg hidrogénatom, halogénatom vagy trihalogén-metil-csoport és
- R_1 1-3 szénatomos alkoxics csoport vagy, 4-6 cikloalkilcsoport, akkor ha R_2 valamely 1-5 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport vagy ciklopropilcsoport, míg R_4 és R_5 az aminocsoporthoz viszonyítva 2-es és 6-os helyzetben állóan egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1-5 szénatomos alkilcsoport, mimellett -X- R_3 4-(4-trifluor-metil-fenoxi)-csoport.



A találmány barbitursav-származékok előállítására alkalmas eljárásra és ezeket a vegyületeket tartalmazó anthelmintikus készítmények előállítására vonatkozik.

A találmány tárgya közelebbről megjelölve, eljárás új 5-fenil-karbamoil-barbitursav-származékok előállítására, amelyek anthelmintikus hatásúak és anthelmintikus készítmények hatóanyagaiként alkalmazhatók. Az anthelmintikus készítmények a házi- és házoonlatokban, mindenek előtt emlősállatokban, élősködő férgek, különösen nematódák, cestódák és trematódák irtására használhatók.

Az 5-fenil-karbamoil-barbitursav-származékok az (I) általános képletnek felelnek meg. Ebben a képletben

R_1 és R_2 egymástól függetlenül 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxycsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy allilcsoport;

R_3 helyettesítetlen naftil-, fenil- vagy piridilcsoport, vagy egyszerűen benzilcsoporttal vagy egyszerűen, kétszeresen vagy háromszorosan halogénatommal, cianocsoporttal, 1-5 szénatomos alkilcsoporttal, trihalogén-metil-csoporttal, dihalogén-metoxi-csoporttal vagy 1-5 szénatomos alkoxycsoporttal helyettesített fenil- vagy piridilcsoport;

R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, trihalogén-metil-csoport, 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-5 szénatomos alkoxycsoport vagy 1-5 szénatomos alkil-tiocsoport és

X jelentése oxigén- vagy kénatom, azzal a megszorítással, hogy

- R_1 jelentése 1-3 szénatomos alkoxycsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy allilcsoport, ha R_2 valamely 1-5 szénatomos alkilcsoport, R_3 trihalogén-metil-csoporttal egyszerűen, kétszeresen vagy háromszorosan helyettesített fenilcsoport, továbbá R_4 és R_5 szubsztituensek mindegyike egyidejűleg hidrogénatom, halogénatom vagy trihalogén-metil-csoport, és

- R_1 jelentése 1-3 szénatomos alkoxycsoport, 4-6 szénatomos cikloalkilcsoport vagy fenilcsoport akkor, ha R_2 valamely 1-5 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport vagy ciklopropilcsoport, míg R_4 és R_5 az aminocsoport-hoz viszonyítva 2-es és 6-os helyzetben állóan egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1-5 szénatomos alkilcsoport, miközben -X- R_3 jelentése 4-(4-trifluor-metil-fenoxi)-csoport.

Az eljárás kiterjed az (I) általános képletnek megfelelő vegyületek tautomer formáinak és sóinak az előállítására is.

Előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek,

1) amelyekben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxycsoport, R_3 helyettesítetlen fenilcsoport vagy helyettesítetlen piridilcsoport vagy egyszerűen vagy kétszeresen halogénatommal, trihalogén-metil-csoporttal vagy 1-5 szénatomos alkilcsoport-

tal helyettesített fenil- vagy piridilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-5 szénatomos alkoxycsoport, halogénatom vagy trihalogén-metil-csoport és X oxigén- vagy kénatom a fentiekben megadott korlátozásokkal,

2) amelyekben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxycsoport; R_3 metilcsoporttal, klóratommal vagy trifluor-metil-csoporttal helyettesített fenilcsoport; míg R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-3 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxycsoport vagy klóratom és X oxigénatom a fenti megszorításokkal, továbbá

3) amelyekben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxycsoport; R_3 metilcsoporttal, klóratommal vagy trifluor-metil-csoporttal helyettesített piridilcsoport; míg R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-3 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxycsoport vagy klóratom és X oxigénatom a fenti megszorításokkal.

Előnyös vegyületek ezek közül a következők:

1,3-dimetil-5-[2-izopropil-4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1,3-dimetil-5-[2,6-dimetil-4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1,3-dimetil-5-[2,3-dimetil-4-(4-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1,3-dimetil-5-[2-(2,4-diklór-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1,3-dimetil-5-[2-(4-metil-fenoxi)-4-metil-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1,3-dimetil-5-[4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1,3-dimetil-5-[4-(5-trifluor-metil-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1-metoxi-3-metil-5-[2-izopropil-4-(4-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1-metoxi-3-metil-5-[2-metil-4-(4-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav,
1,3-dimetil-5-[3-(2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi)-4-metil-fenil-karbamoil]-barbitursav.

Az (I) általános képletű vegyületek számításba jöhető sói közé számítanak például az alkálifém-, ammónium- vagy az aminosók, mimellett a nátrium-, kálium-, ammónium- vagy az alkil-amin-sók, különösen a trietil-amin-sók előnyösek.

Az (I) általános képletű vegyületeknél az alkilcsoport megjelölés egyedül álló csoportokra, valamint az R_1 - R_5 szubsztituensek részeként előforduló egyenes és elágazó láncú alkilcsoportokra egyaránt vonatkozik. Ilyen csoportok például a metil-, etilcsoportok, valamint a propil-, butil- és a pentilcsoport izomerjei. A cikloalkilcsoport megjelölés a ciklopropil-, ciklobutil-, ciklopentil- és a ciklohexilcsoportot értjük. A halogénatom megjelölése a fluor-, klór-, bróm- vagy jód-atomra, különösen a fluor- és a klóratomra vonatkozik.

5-fenil-karbamid-barbitursav-származékok a 7.541 számú európai találmányi bejelentésben vannak leírva inszekticid hatóanyagokként, valamint rovarok fejlődését akadályozó anyagokként. Ezek a vegyületek az (A) általános képletnek felelnek meg. Ebben a képletben

$R^1 = H$, alkilcsoport,

$R^2 = H$, alkilcsoport,

$R^3 =$ halogén-alkil-csoport, halogén-alkil-csoporttal helyettesített fenilcsoport,

$X = O, S$,

$Y =$ halogénatom, halogén-alkil-csoport,

$n = 0, 1, 2$ szám,

$X-R_3$ és $Y =$ egymáshoz viszonyítva orto helyzetben lévő $-O-CF_2-O-CF_2-$ csoportot is jelenthet.

A találmány szerinti eljárással előállítható (I) általános képletű vegyületek szerkezetileg különböznek a 7.541 számú európai találmányi bejelentésben leírt barbitursav-származékoktól. Ezenkül meglepő módon azt találtuk, hogy az új vegyületek kedvező hatás-spektrumot mutatnak az állati szervezetekben, mindenekelőtt emlősállatok szervezetében élősködő parazita férgek ellen. Így tehát jó hatással alkalmazhatók nematódák, cestódák és trematódák ellen. Emellett ezek a hatóanyagok mindenekelőtt azzal tűnnek ki, hogy teljesen hatásosak benzimidazollal, különösen tiabendazollal szemben rezisztens fajták ellen, mimellett a 'tiabendazol' megnevezésen a 2-(4-tiazolil)-benzimidazol hatóanyagot értjük. Emellett az (I) általános képletű vegyülete kifejezett inszekticid tulajdonságokat mutatnak és ezek a tulajdonságok alkalmassá teszik ezeket a vegyületeket arra, hogy keratinpusztító rovarok irtására használjuk őket.

Az (I) általános képletű barbitursav-származékokat úgy állítjuk elő, hogy

a) valamely (II) általános képletű észtert egy (III) általános képletű anilinszármazékkal reagáltatunk, e képletekben R 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy adott esetben nitrocsoporttal helyettesített fenilcsoport, míg R_1-R_3 és X jelentése az előzőekben megadottakkal egyezik, vagy

b) valamely (IV) általános képletű helyettesített barbitursavat egy (V) általános képletű helyettesített fenilzociánáttal reagáltatunk, e képletben R_1-R_3 és X jelentése a fenti, vagy

c) valamely (IV) általános képletű helyettesített barbitursavat egy (IV) általános képletű helyettesített benzoid-aziddal reagáltatunk, e képletben R_1-R_3 és X jelentése a fenti, és kívánt esetben az a), b) vagy c) eljárással kapott szabad savat ismert módon sójává alakítjuk.

Az a) és c) eljárásokat $50\text{ }^\circ\text{C}$ és $250\text{ }^\circ\text{C}$ közötti, előnyösen $70\text{ }^\circ\text{C}$ - $220\text{ }^\circ\text{C}$ közötti reakcióhőmérséklettartományban vitelezzük ki. A b) eljárást $0-220\text{ }^\circ\text{C}$, különösen $0-200\text{ }^\circ\text{C}$ hőmérséklettartományban játszhatjuk le. Az a),

b) és c) eljárásokat légköri vagy növelt nyomáson oldószer nélkül vagy előnyösen a reakcióval szemben közömbös oldó- vagy hígítószerekben hajtjuk végre, mimellett egyes esetekben előnyösen valamely bázissal dolgozunk.

Az (I) általános képletű vegyületek sóit szokásos módon úgy állítjuk elő, hogy a szabad savat valamely bázissal, különösen fiziológiailag elviselhető bázissal semlegesítjük. Előnyös sókként megemlítjük a nátrium-, kálium- vagy lítiumsókat, valamint az ammóniumsókat és a trialkil-amin-sókat, így például az előnyös trietil-amin-sót. A semlegesítést valamely a reakcióval szemben közömbös poláros oldószerben, például alkanolban, észterben vagy éterszerű vegyületben végezzük.

A találmány szerinti hatóanyagok előállításához alkalmas oldó- vagy hígítószerek például az éterek és az éterszerű vegyületek, így a dialkil-éterek (dietil-éter, diizopropil-éter, terc-butil-metil-éter és hasonló), az anizol, dioxán, tetrahidrofuran; alifás és aromás szénhidrogének, így a benzol, toluol, petroléter; halogénezett szénhidrogének, így a klór-benzol, metilén-klorid, kloroform, etilén-klorid, szén-tetraklorid, tetraklór-etilén; nitrilek, így az acetonitril, propionitril; N,N-dialkilezett amidok, így a dimetil-formamid; dimetil-szulfoxid; ketonok, így az acetone, dietil-keton, metil-etil-keton és ilyen oldószerek egymással alkotott elegyei.

Bázisokként szerves és szervetlen bázisok jönnek számításba, például előnyösen a terciar aminok, így a trialkil-aminok (tri-etil-amin, trietil-amin, tripropil-amin és hasonló), a piridin és piridinbázisok (például a 4-dimetil-amino-piridin, 4-pirrolidil-amino-piridin és hasonló), a pikolin és a lutidin, valamint az oxidok, hidroxidok, és karbonátok és hidrogénkarbonátok, így az alkálifém-, és alkáliföldfém-oxidok, -hidroxidok, -karbonátok és -hidrogénkarbonátok [például a CaO , BaO , $NaOH$, KOH , $Ca(OH)_2$, $KHCO_3$, $NaHCO_3$, $Ca(HCO_3)_2$, K_2CO_3 , Na_2CO_3 és hasonló], továbbá az acetátok, így például a CH_3COONa vagy a CH_3COOK . Ezen túlmenően bázisokként alkalmasak alkáli-alkoholátok is, így például a nátrium-etilát, nátrium-propilát, kálium-terc-butilát vagy a nátrium-metilát. A bázist előnyösen 10-100% mólegyenértéknyi mennyiségben alkalmazzuk a reagensekre számítva.

Egyes esetekben előnyös lehet, ha a reakciót védőgáz légkörben vitelezzük ki, alkalmas védőgázok például a nitrogén, hélium, argon vagy a széndioxid.

Az (I) általános képletű szabad sav bázisokkal való reagáltatása ugyancsak a találmányhoz tartozó sókat eredményez.

Az a), b) és c) eljárásoknál említett kiindulási anyagok ismertek [például Chem. Ber. 54, 1038 (1921)] vagy az ismert anyagok elő-

állítására alkalmas eljárásokhoz hasonló módszerekkel előállíthatók.

A leírt a), b) és c) eljárások a találmány körébe tartoznak.

Az (I) általános képletű hatóanyagok különböző tautomer formákban létezhetnek, mégpedig keto- vagy enolformában vagy a keto- és enolforma elegyeként. Az eljárás kiterjed mind az egyes tautomerek, mind ezek elegyeinek, valamint ezek sóinak az előállítására is.

A találmány alkalmas állatoknak parazita férgek elleni megelőző védelmére. E védelem abban áll, hogy az (I) általános képletű hatóanyagokat, illetve az ilyen hatóanyagokat tartalmazó készítményeket adalékként hozzáadjuk a takarmányhoz vagy az ivóvízhez, de alkalmazhatjuk szilárd vagy folyékony formában orálisan is, illetve injekció formájában vagy külsőleg, bőrön át adhatjuk az állatoknak. Ezenkívül az (I) általános képletű hatóanyagokat tartalmazó készítményeket felhasználhatjuk rovarok, különösen keratinpusztító rovarok irtására; alkalmazásukkal megvédjük a keratint, illetve a keratintartalmú anyagokat attól, hogy a keratinpusztító rovarok felfalják azokat. Az eljárás során a védendő anyagot az (I) általános képletű hatóanyagokat tartalmazó készítményekkel kezeljük.

A találmány magában foglalja az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítását is. Az eljárás abban áll, hogy a hatóanyagot megfelelő vízóanyagokkal vagy adalékanyagokkal összekeverjük.

A találmány szerinti készítményekben valamint a rovarok irtására alkalmas kártevőirtó szerekben az (I) általános képletű hatóanyagok minden tautomer formában, ezek elegyeiként vagy sóformában alkalmazhatók.

A melegvérűeknél előforduló endoparaziták, mégpedig a helminthek (férgek) súlyos károkat okoznak. Így például az ilyen paraziták által megtámadott állatok nem csak fejlődésükben maradnak el, hanem e paraziták olyan károsodásokat is okozhatnak, amelyek az állatok pusztulásához vezethetnek. Éppen ezért különösen nagy jelentősége van annak, hogy olyan gyógyászati készítményeket fejlesszünk ki, amelyek alkalmasak a férgek és ezek különböző fejlődési állapotának a pusztítására, valamint annak megelőzésére, hogy ezek a paraziták megtámadhassák az állatokat. Különösen veszélyes féregbetegségek azok, amelyeket a gyomor- és bélrendszerben vagy más szervezetelekben élősködő nematódák, cesztódák és trematódák okoznak és amelyek mindenekelőtt a kérődzőknél, így a juhoknál, szarvasmarháknál és kecskéknél, valamint a lovaknál, sertéseknél, szarvasoknál, kutyáknál, macskáknál és a szárnyasoknál fordulnak elő.

A helminthiázis által okozott károkat a féregbetegségek krónikus és mindenekelőtt járványos fellépése esetén jelentős károkat

okozhatnak a szarvasmarhaállományban. E betegségek által okozott károkat többek között a termelékenység csökkenésében, az ellenállóerő gyengülésében és a pusztulás növekedésében jutnak kifejezésre. A féregbetegségek megakadályozása és fellépésüknek a megelőzése ezért elsőrendű feladat azért, hogy ilyen fajta, mindenekelőtt népgazdasági szempontból súlyos károkat elkerüljünk vagy ezeket legalább csökkentjük.

A leírásban a „helminthek” (férgek) megjelölésen különösen olyan parazita férgeket értünk, amelyek a Platyhelminthes (cesztódák, trematódák) és a Nematelminthes (nematódák és rokonaik) törzsekhez tartoznak, tehát szalagférgeket, szívóférgeket és galandférgeket, amelyek a gyomor- bélrendszerben és más szervekben (például a májban, tüdőben, vesében, nyirokedényekben, vérben) élősködnek. Ismeretes már egy sor anthelmintikus hatású szer, amelyek a különböző féregfajták irtására használhatók. Ezek a szerek azonban nem tudják teljesen kielégíteni a követelményeket, mivel az elviselhető adagoknál hatás-spektrumuk kihasználása nem lehetséges vagy terápiásan hatáson adagok használata esetén nem kívánt mellékhatásokat vagy tulajdonságokat mutatnak. Ezzel összefüggésben bizonyos vegyületsorozatokkal szemben manapság fokozottan fellépő rezisztencia is egyre jelentősebb szerepet játszik. Így például az irodalomban leírt „Albendazol” [1 464 326 számú brit szabadalom; Am. J. Vet. Res. 38, 1425-1426 (1977); Am. J. Vet. Res. 37, 1515-1516 (1976); Am. J. Vet. Res. 38, 807-808 (1977); Am. J. Vet. Res. 38, 1247-1248 (1977)] rendelkezik ugyan bizonyos korlátozott anthelmintikus hatás-spektrummal kérődzőknél, de hatása benzimidazolnak ellenálló nematódák és idült májméltelen ellen nem kielégítő, és elsősorban ez utóbbinak a patológiailag fontos kifejletlen vándorló formái ellen hatástalan az elviselhető adagoknál haszonállatok esetében.

Meglepő módon azt találtuk, hogy az (I) általános képletű hatóanyagok széles hatás-spektrummal rendelkező erőteljes anthelmintikus hatást mutatnak nematódák, cesztódák és trematódák ellen és emellett melegvérűekkel szembeni toxicitásuk csekély.

Az (I) általános képletű hatóanyagokat tartalmazó készítmények a következő rendekhez tartozó parazita nematódák irtására alkalmasak (K. I. Skrajabin szerint):

Rhabditida,
Ascaridida,
Spirurida,
Trichocephalida,

használhatók továbbá a cesztódák rendjéhez tartozó férgek irtására (Wardle and McLeod szerint), ilyenek a

Cyclophyllidae,
Pseudophyllidae,

vagy a trematódák rendjéhez tartozó férgek pusztítására, ilyenek a

Digenea

fajták. Ezek a férgek különböző házi- és házsonállatokban, így szarvasmarhákban, juhokban, kecskékben, lovakban, sertésekben, macskákban, kutyákban és szárnyasokban élőködnek. A készítmények az állatoknak egyetlen dózis alakjában, vagy ismételt adagokban adhatók be. Egyszeri beadás esetén az állatfajtól függően az adagok nagysága 1-500 mg hatóanyag testsúlykilogrammonként. Elnyújtott beadás útján bizonyos esetekben jobb hatást érünk el vagy ugyanazt a hatást kisebb adagokkal elérhetjük.

Az említett találmány szerinti készítményeket úgy állítjuk elő, hogy az (I) általános képletnek megfelelő hatóanyagokkal folyékony és/vagy szilárd formázó segédanyagokkal lépésenként összekeverjük és/vagy összeőröljük, így egymással érintkezésbe hozzuk azokat, így alkalmazásra kész formázott készítményt kapunk, amely optimálisan fejti ki anthelmintikus hatását.

A formázási lépéseket dagasztással, granulálással (granulátumok) és adott esetben sajtolással (pellet) kiegészíthetjük.

Formázó segédanyagokként például szilárd vivóanyagok, oldószerek és adott esetben felületaktív anyagok (tenzidok) szolgálnak.

A találmány szerinti készítmények előállítására a következő formázási segédanyagokat alkalmazzuk:

Szilárd vivóanyagok, így például a kaolin, talkum, bentonit, konyhasó, kalcium-foszfát, szénhidrátok, cellulózpor, gyapotmagliszt, polietilén-glikoléter, adott esetben kötőanyagok, így például a zselatin, oldható cellulóz-származékok, kivánt esetben felületaktív anyagok, így ionos vagy nemionos diszpergáló szerek hozzáadása mellett, továbbá természetes közetlisztek, így a kalcit, montmorillonit vagy az atapulgit. A fizikai tulajdonságok javítására nagy diszperzításfokú kovasavat vagy nagy diszperzításfokú nedvszívóképes polimerizátumokat is adagolhatunk. Szemcsézett, adszorpcióképes granulátumhordozóként porózus típusú anyagok jönnek számításba, így például a horzszakó, a téglatörmelék, szepiolit vagy a bentonit, nem szorpcióképes vivóanyagokként pedig például a kalcit vagy a homok jönnek számításba. Ezen túlmenően nagy előgranulált szeretlen vagy szerves eredetű anyagot, így különösen dolomitot vagy aprított növényi anyagot is alkalmazhatunk.

Oldószerekként számításba jönnek az aromás szénhidrogének, előnyösen a C_6 - C_{12} frakciók, így például a xilolegyek vagy a helyettesített naftalinok, a ftálsavészterek, így a dibutil- vagy dioktil-ftalát; alifás szénhidrogének, így például a ciklohexán vagy a paraffinok, alkoholok és glikolok, valamint ezek étereit és észtereit, így például az etanol, etilén-glikol, etilén-glikol-monometil- vagy etil-éter, ketonok, így például a ciklo-

hexanon, erősen poláros oldószerek, így például az N-metil-2-pirrolidon, dimetil-szulfoxid vagy a dimetil-formamid, valamint adott esetben epoxidált növényolajok, így például az epoxidált kókuszdióolaj vagy szójabólj és a víz.

Felületaktív vegyületekként a formázandó (I) általános képletű hatóanyag milyensége szerint nem-ionos, kationos és/vagy anionos tenzidok jönnek számításba, amelyek jó emulgeáló, diszpergáló és nedvesítő tulajdonságokkal rendelkeznek. Tenzidok tenzidelegyeket is értünk.

Alkalmos anionos tenzidok mind az úgynevezett vízoldható szappanok, mind pedig a vízoldható szintetikus felületaktív vegyületek lehetnek.

Szappanokként nagyobb szénatomszámú, így 10-22 szénatomos zsírsavak alkálifém-, alkáliföldfém- vagy adott esetben helyettesített ammóniumsói, így például az olajsav vagy a sztearinsav Na- vagy K-sói, vagy olyan természetes zsírsavegyek fent említett sói, amelyek például kókuszdió- vagy faggyúolajból kaphatók, jöhetnek számításba.

Gyakran úgynevezett szintetikus tenzidokat alkalmazunk. Ilyen tenzidok elsősorban a zsírszulfonátok, zsírszulfátok, szulfonált benzimidazol-származékok vagy az alkilszulfonátok.

Zsírszulfonátok vagy -szulfátok rendszerint alkálifém-, alkáliföldfém- vagy adott esetben helyettesített ammóniumsók formájában vannak jelen és 8-22 szénatomos alkilrésszel rendelkeznek, mimellett az alkilrésszhez az acilcsoportok alkilrészét is besoroljuk. Ilyen például a ligninszulfonsav, a dodecilszulfonsav vagy valamely természetes zsírsavból előállított zsíralkoholszulfátelegy Na- vagy Ca-sói. Ide tartoznak a kénsavészterek és a zsíralkohol-etilénoxid-adduktumok szulfonsavainak a sói is. A szulfonált benzimidazol-származékok előnyösen 2 szulfonsavcsoportot és egy 8-22 szénatomos zsírsavrésszel rendelkeznek. Alkil-arilszulfonátok például a dodecyl-benzolszulfonsav, a dibutil-naftalinszulfonsav vagy valamely naftalinszulfonsav-formaldehidkondenzációs termék Na-, Ca- vagy trietanolaminsói lehetnek.

Számításba jönnek továbbá a megfelelő foszfátok is, így például valamely p-nonil-fenol-(4-14)-etilénoxid-adduktum foszforsavészterének a sói.

Nem-ionos tenzidekként elsősorban alifás vagy cikloalifás alkoholok, telített vagy telítetlen zsírsavak és alkil-fenolok poliglikol-éterszármazékai jönnek számításba, amelyek 3-30 glikolétercsoportot, az (alifás) szénhidrogénrészben 8-20 szénatomot és az alkilfenol alkilrészében 6-18 szénatomot tartalmaznak.

További alkalmas nem-ionos tenzidok a vízoldható, 20-250 etilén-glikolétercsoportot és 10-100 propilén-glikolétercsoportot tartalmazó polietilén-oxid-adduktumok polipropilén-glikol-

ra, etiléndiamino-polipropilén-glikolra és olyan alkil-polipropilén-glikolra számítva, amely az alkil-láncban 1-10 szénatomot tartalmaz. Az említett vegyületek szokásosan 1-5 etilén-glikolegységet tartalmaznak egy propilén-glikol-egységre számítva.

Nem-ionos tenzidekként a nonilfenol-poli-etoxi-etanolokat, a ricinusolaj-poliglikolétereket, a propilén-poli-eti-lénoxid-adduktumokat, a tributilfenoxi-poli-etoxi-etanol, a poli-eti-lénglikolt és az oktilfenoxi-poli-etoxi-etanol említjük meg.

Számításba jönnek továbbá a poli-etoxi-eti-lén-szorbitán zsírsavészterei is, így a poli-etoxi-eti-lén-szorbitán-trioleát.

Kationos tenzidek mindenképp előtt a kvaterner ammóniumsók, amelyek N-szubsztituensként legalább egy 8-22 szénatomos alkil-csoportot tartalmaznak, további helyettesítők pedig rövidszénláncú, adott esetben halogénezett alkil-, benzil- vagy rövidszénláncú hidroxil-alkilcsoportok lehetnek. A sók előnyösen halogénidek, metil-szulfátok vagy etil-szulfátok, például a sztearin-trimetil-ammónium-klorid vagy a benzil-di(2-klór-etil)-etil-ammónium-bromid lehetnek.

A formázási eljárásnál használatos tenzidek többek között a következő irodalmi helyeken vannak leírva:

„Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual” MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1980,

Sisley and Wood, „Encyclopedia of Surface Active Agents”, Chemical Publishing CO., Inc. New York, 1980.

Tablettákhoz és boluszokhoz használható kötőanyagokként kémiaiilag átalakított, vízben vagy alkoholban oldható, polimer természetes anyagok jönnek számításba. Ilyenek például a keményítő-, cellulóz- vagy a protein-származékok [például a metil-cellulóz, karboxi-metil-cellulóz, etil-hidroxil-etil-cellulóz, proteinek, így a tengeripropamin (zein), zselatin és hasonlók], valamint a szintetikus polimerek, így például polivinil-alkohol, polivinil-pirrolidon és hasonlók. A tabletták tartalmaznak töltőanyagokat is (így keményítőt, mikrokristályos cellulózt, cukrot, tejcukrot és hasonlók), továbbá csúsztató szereket és szétesést elősegítő anyagokat.

Amennyiben az anthelmintikus szerek takarmánykoncentrátumok alakjában készülnek, akkor vivőanyagokként például tápszerek és takarmánygabonák vagy proteinkoncentrátumok szolgálnak. Ilyen takarmánykoncentrátumok vagy -szerek a hatóanyagon kívül még adalékanyagokat, vitaminokat, antibiotikumokat, kemoterápiás szereket, vagy más peszticideket, előnyösen bakteriosztatikumokat, fungisztatikumokat, kokcidiosztatikumokat vagy hormonkészítményeket, olyan analóg hatású vagy növekedést segítő anyagokat is tartalmazhatnak, amelyek a vágóállatok húsának a minőségét befolyásolják vagy más módon hasznosak a szervezetre. Amennyiben a

szereket vagy a bennük lévő (I) általános képletű hatóanyagokat közvetlenül adjuk a takarmányhoz vagy az állatok ivóvizéhez, akkor a kész takarmány vagy az elkészített ivóvíz a hatóanyagokat körülbelül 0,0005-0,02 súlyszázalék (5-200 ppm) koncentrációban tartalmazza.

A találmány szerinti szereket a kezelendő állatoknak orálisan, parenterálisan, szubkután vagy topikálisan adhatjuk be. A szerek oldatok, emulziók, szuszpenziók (drench), porok, tabletták, boluszok és kapszulák alakjában készülnek.

A találmány szerinti anthelmintikus szerek rendszerint 0,1-99 súly%, különösen 0,1-95 súly%, (I) általános képletű hatóanyagot, 99,9-1 súly%, különösen 99,8-5 súly%, szilárd vagy folyékony adalékanyagot, ezek között 0-25 súly%, különösen 0,1-25 súly%, tenzidet tartalmaznak.

A kereskedelmi termékek főként koncentrált formában kerülnek forgalomba, az egyéni felhasználók ellenben a hígított formát kedvelik.

A találmány szerinti készítmények még további adalékokat, így stabilizáló szereket, habzágátlókat, viszkozitásszabályozókat, kötőanyagokat, valamint speciális hatások eléréséhez szükséges más hatóanyagokat is tartalmazhatnak.

A következő példák a találmány részletesebb bemutatására szolgálnak, de a találmány köre nem korlátozódik csupán a bemutatott formákra.

1. Előállítási példák

1.1. 1,3-dimetil-5-(2,3-dimetil-4-(4-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil)-barbitursav

1,60 g (0,007 mól) 1,3-dimetil-5-etoxi-karbonil-barbitursavat és 1,95 g (0,007 mól) 2,3-dimetil-4-(4-trifluor-metil-fenoxi)-anilint 20 ml toluolban szuszpendálunk és a szuszpenziót 16 óra hosszat visszafolyatás közben melegítjük, amelynek során etanol távozik. Ezután az elegyet lehűtjük, a csapadékot szűrővel elkülönítjük, toluollal utánamoszuk és szárítjuk.
Kitermelés: 2,9 g (az elméleti hozam 90%-a).
Op. 196-197 °C.

1.2. 1,3-dimetil-5-(4-metil-2-(4-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil)-barbitursav

11,41 g (0,005 mól) 1,3-dimetil-5-etoxi-karbonil-barbitursavat és 10,7 g (0,050 mól) 4-metil-2-(4-metil-fenoxi)-anilint 200 ml etanol és 15 ml dimetil-formamid elegyében szuszpendálunk, majd a szuszpenziót védőgáz-áramban (nitrogén-gáz légkörben) 18 óra hosszat visszafolyatás közben melegítjük. Az

elegyet ezután lehűtjük, a csapadékot szűrővel elkülönítjük, acetonnal utánamoszuk és szárítjuk.

Kitermelés 18,6 g (az elméleti hozam 94%-a).
Op. 214-216 °C.

1.3. *1,3-dimetil-5-[2-izopropil-4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav*

6,85 g (0,030 mól) 1,3-dimetil-5-etoxi-karbonil-barbitursavat és 8,85 g (0,030 mól) 2-izopropil-4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-anilint 75 ml toluolban szuszpendálunk és a szuszpenziót védőgázamban (nitrogéngáz légkörben) 16 óra hosszat visszafolyatás közben melegítjük, amelynek során etanol távozik az elegyből. Ezután a toluolt ledesztilláljuk és a maradékot 400 ml abszolút etanolból átkristályosítjuk.

Kitermelés 12,6 g (az elméleti hozam 88%-a).
Op. 143-145 °C.

1.4. *1,3-dimetil-5-[2,6-dimetil-4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav*

6,85 g (0,030 mól) 1,3-dimetil-5-etoxi-karbonil-barbitursavat és 7,95 g (0,030 mól) 2,6-dimetil-4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-anilint 75 ml toluolban szuszpendálunk és a szuszpenziót 16 óra hosszat visszafolyatás közben melegítjük, amelynek során etanol távozik. Ezután a toluol kétharmadát ledesztilláljuk. A csapadékot lehűtés után szűrővel elkülönítjük, etanollal utánamoszuk és szárítjuk.

Kitermelés: 10,6 g (az elméleti hozam 76%-a).
Op. 148-150 °C.

1.5. *1,3-dimetil-5-[5-(2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi)-2-metoxi-fenil-karbamoil]-barbitursav*

1,60 g (0,007 mól) 1,3-dimetil-5-etoxi-karbonil-barbitursavat és 2,22 g (0,007 mól) 5-(2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi)-2-metoxi-anilint feloldunk 15 ml etanolban és 18 óra hosszat visszafolyatás közben melegítjük az oldatot. Ezután az elegyet lehűtjük, a kivált csapadékot szűrővel elkülönítjük, etanollal utánamoszuk és szárítjuk.

Kitermelés: 2,9 g (az elméleti hozam 83%-a).
Op. 188-189 °C.

1.6. *1-ciklopropil-3-metil-5-[4-klór-2-(4-klór-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav*

8,5 g (0,050 mól) 1-ciklopropil-3-metil-barbitursavat és 14,0 g (0,050 mól) 4-klór-2-(4-klór-fenoxi)-fenil-izocianátot 50 ml xilolban szuszpendálunk és a szuszpenzióhoz

cseppenként hozzáadunk 1 g (0,010 mól) trietil-amint. A hőmérséklet ekkor 45-50 °C-ra emelkedik. Az elegyhez további 50 ml xilolt adunk és az egészet 18 óra hosszat ezen a hőmérsékleten keverjük. Ezt követően a xilol

1/3 részét ledesztilláljuk, majd az elegyet lehűtjük. A kivált csapadékot szűrővel elkülönítjük, xilollal utánamoszuk, 1 n HCl-oldatban szuszpendáljuk több alkalommal, majd vízzel alaposan mossuk és szárítjuk.

Kitermelés: 19,0 g (az elméleti hozam 85%-a).
Op. 215-217 °C.

1.7. *1,3-dimetil-5-[4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav*

1,60 g (0,007 mól) 1,3-dimetil-5-etoxi-karbonil-barbitursavat és 1,79 g (0,007 mól) 4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-anilint 25 ml toluolban szuszpendálunk és a szuszpenziót 16 óra hosszat visszafolyatás közben melegítjük, amelynek során etanol távozik el. Az elegyet ezután lehűtjük, a csapadékot szűrővel elkülönítjük, etanollal mossuk és szárítjuk.

Kitermelés: 2,7 g (az elméleti hozam 89%-a).
Op. 234-235 °C.

1.8. *1,3-dimetil-5-[4-(5-trifluor-metil-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav*

1,60 g (0,007 mól) 1,3-dimetil-5-etoxi-karbonil-barbitursavat és 1,75 g (0,007 mól) 4-(5-trifluor-metil-piridil-2-oxi)-anilint 20 ml toluolban szuszpendálunk és a szuszpenziót 16 óra hosszat visszafolyatás közben melegítjük, amelynek során etanol távozik el. Az elegyet ezután lehűtjük, a csapadékot szűrővel elkülönítjük, etanollal utánamoszuk és szárítjuk.

Kitermelés: 2,7 g (az elméleti hozam 89%-a).
Op. 180-181 °C.

1.9. *1,3-dimetil-5-[4-(5-trifluor-metil-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav*

11,41 g (0,005 mól) 1,3-dimetil-5-etoxi-karbonil-barbitursavat és 12,7 g (0,050 mól) 4-(5-trifluor-metil-piridil-2-oxi)-anilint 200 ml etanol és 15 ml dimetil-formamid elegyében szuszpendáljuk és védőgázban (nitrogéngáz légkörben) 18 óra hosszat visszafolyatás közben melegítjük. Ezután az elegyet lehűtjük, a csapadékot szűrővel elkülönítjük, acetonnal utánamoszuk és szárítjuk.

Kitermelés: 19,5 g (az elméleti hozam 90%-a).
Op. 180-181 °C.

1.10. *1,3-dimetil-5-[4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav*

65

7,8 g (0,050 mól) 1,3-dimetil-barbitursavat és 14,0 g (0,050 mól) 4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenil-izocianátot 50 ml xilolban szuszpendálunk és a szuszpenzióhoz cseppenként hozzáadunk 1 g (0,010 mól) trietil-amint. Az elegyhez további 50 ml xilolt adunk és az egészet 18 óra hosszat ezen a hőmérsékleten keverjük. Ezt követően a xilol 1/3 részét ledesztilláljuk és a maradékot lehűtjük. A kivált csapadékot szűrővel elkülönítjük, xilollal utánamoszuk, 1 n HCl-oldatban többször szuszpendáljuk, utána vízzel alaposan mossuk és szárítjuk.

1.11. 1,3-dimetil-5-[4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav

4,0 g (0,01 mól) 4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-benzoiil-azid 50 ml toluollal készített oldatához hozzáadunk 1,56 g (0,01 mól) 1,3-dimetil-barbitursavat. Ezt követően 0,02 g (0,002 mól) trietil-amin 5 ml toluollal készített oldatát adjuk az oldathoz cseppenként szobahőmérsékleten. Az elegyet ezután 1 óra hosszat 50 °C-on keverjük, majd a hőmérsékletet 20 °C-onként emeljük mindaddig, ameddig a visszafolyatási hőmérsékletet el nem ériük. A visszafolyatási hőmérsékletet a nitrogénfejlődés befejeződéséig fenntartjuk. A reakcióelegyet ezután lehűtjük, a kivált csapadékot szűrővel elkülönítjük, etanollal utánamoszuk, 1 n HCl-oldatban többször szuszpendáljuk és ezt követően vízzel alaposan mossuk, majd szárítjuk. Kitermelés 4 g (az elméleti hozam 85%-a). Op. 234-235 °C.

A megelőző lépésben alkalmazott benzoiil-azidot a következő módon állítjuk elő:

6,7 g (0,024 mól) 3,5-diklór-piridil-2-oxi-benzoesavhoz 40 ml acetonban 0 °C-on hozzáadunk 3,4 g (0,031 mól) klórhangyasav-etilésztert 2,9 g (0,028 mól) trietil-amin jelenlétében. Ezt követően 2,4 g (0,036 mól) nátrium-azidot adunk 8 ml vízben oldva az elegyhez. Az egészet három óra hosszat keverjük 0 °C-on, utána 100 ml vízbe öntjük és 60 ml toluollal extraháljuk. A toluolos fázist elkülönítjük, nátrium-szulfát felett 0 °C-on szárítjuk és szűrjük. A kapott anyagot a fent leírt reakciónál alkalmazzuk.

1.12. 1,3-dimetil-5-[4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav

7,8 g (0,050 mól) 1,3-dimetil-barbitursav és 18,0 g (0,050 mól) 4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-benzoiil-azid 50 ml xilollal készített szuszpenziójához cseppenként hozzáadunk 1 g (0,010 mól) trietil-amint. A hőmérséklet 45-50 °C-ra emelkedik. Ezután további 50 ml xilolt adunk az elegyhez és az egészet 18

óra hosszat keverjük ezen a hőmérsékleten. Ezt követően a xilol 1/3 részét ledesztilláljuk, a maradékot lehűtjük, a csapadékot szűrővel elkülönítjük, xilollal utánamoszuk, 1 n HCl-oldatban többször szuszpendáljuk, ezután vízzel alaposan mossuk és szárítjuk. Kitermelés: 19,0 g (az elméleti hozam 85%-a). Op. 234-235 °C.

1.13. 1,3-dimetil-5-[4-(2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav

3,4 g (0,01 mól) 4-(2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi)-benzoiil-azid 50 ml toluollal készített oldatához hozzáadunk 1,56 g (0,01 mól) 1,3-dimetil-barbitursavat. Ezt követően 0,02 g (0,002 mól) trietil-amin 5 ml toluollal készített oldatát csepegtetjük az oldathoz szobahőmérsékleten. Az elegyet ezután 1 óra hosszat 50 °C-on keverjük és a hőmérsékletet 20 °C-onként emeljük mindaddig, ameddig a visszafolyatási hőmérsékletet el nem ériük. A visszafolyatási hőmérsékletet a nitrogén-gáz fejlődésének a megszűnéséig fenntartjuk. Ezután az elegyet lehűtjük és először 1 n HCl-oldattal, majd vízzel mossuk, a toluolfázist elkülönítjük és nátrium-szulfát felett szárítjuk. A toluolos oldathoz petrolétert adunk és így a termék kicsapódik. A csapadékot szűrővel elkülönítjük, etanollal mossuk és szárítjuk. Kitermelés: 2,5 g (az elméleti hozam 55%-a). Op. 156-158 °C.

Az előző lépésben alkalmazott benzoiil-azidot a következő módon állítjuk elő:

7,5 g (0,024 mól) 4-(2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi)-benzoesavhoz 40 ml acetonban 0 °C-on hozzáadunk 3,4 g (0,031 mól) klórhangyasav-etilésztert 2,9 g (0,028 mól) trietil-amin jelenlétében. Az elegyhez ezután hozzáadunk 2,4 g (0,036 mól) nátrium-azidot 8 ml vízben oldva. Az egészet 0 °C-on keverjük 3 óra hosszat, utána 100 ml vizet adunk hozzá és 60 ml toluollal extraháljuk. A toluolos fázist elkülönítjük, nátrium-szulfát felett 0 °C-on szárítjuk és szűrjük. A kapott anyagot a fenti reakciónál alkalmazzuk.

További (I) általános képletű vegyületeket az 1. táblázatban adunk meg.

1. Táblázat

(Ia) általános képletű vegyületek

Vegy. száma	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	X	R ₃	Fizikai állandók (°C)
A/1	C ₂ H ₅ -	C ₂ H ₅ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ -t-C ₆ H ₅ -(4)-	Op. 144-146
A/2	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₃ CN(2)CF ₃ (4)-	Op. 214-215
A/3	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ CN(2)CF ₃ (4)-	Op. 204-207
A/4	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CF ₃	H	O	C ₆ H ₄ OCF ₂ H(4)-	Op. 148-150
A/5	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl(4)OCF ₂ H(3)-	Op. 180-183
A/6	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	Op. 148-150
A/7	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 189-191
A/8	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ F(4)-	Op. 211-213
A/9	CH ₃ -	CH ₃ -	2-i-C ₃ H ₇ -	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	Op. 143-145
A/10	CH ₃ -	CH ₃ -	2-i-C ₃ H ₇ -	H	O	C ₆ H ₃ Cl(3)CF ₃ (4)-	Op. 139-141
A/11	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₃ Cl(3)CF ₃ (4)-	Op. 209-211
A/12	CH ₃ -	ciklohexil	2-i-C ₃ H ₇	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	Op. 157-158
A/13	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	3-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	Op. 196-197
A/14	C ₂ H ₅ -	C ₂ H ₅ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ -t-C ₆ H ₅ -(4)-	Op. 144-146
A/15	CH ₃ -	CH ₃ -	2-SCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 195-196
A/16	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CF ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 172-173
A/17	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CF ₃	H	O	C ₆ H ₄ -i-C ₃ H ₇ (4)-	Op. 146-147
A/18	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ -i-C ₃ H ₇ (4)-	Op. 148-150
A/19	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₂ (CH ₃) ₂ (3,5)Cl(4)-	Op. 234-235
A/20	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₅ -	Op. 218-220
A/21	CH ₃ -	CH ₃ -	2-i-C ₃ H ₇	6-i-C ₃ H ₇ -	O	C ₆ H ₄ CH ₃ (4)-	Op. 211-212
A/22	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ (benzil)(4)-	Op. 162-163
A/23	CH ₃ -	CH ₃ -	2-C ₂ H ₅	6-szek-C ₄ H ₉ -	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 124-126
A/24	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	5-Cl	O	C ₆ H ₄ SCH ₃ (4)-	Op. 252-254
A/25	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,4)-	Op. 210-212
A/26	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 183-184
A/27	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,4)	Op. 210-212
A/28	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 209-210
A/29	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	H	S	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 200-202
A/30	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (2)-	
A/31	CH ₃ -	CH ₃ -	2-C ₂ H ₅	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
A/32	CH ₃ -	CH ₃ -	2-C ₂ H ₅	H	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
A/33	CH ₃ -	CH ₃ -	3-C ₂ H ₅	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
A/34	CH ₃ -	CH ₃ -	3-C ₂ H ₅	H	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
A/35	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	5-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
A/36	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	5-CH ₃	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
A/37	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	5-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
A/38	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	5-CH ₃	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
A/39	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
A/40	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
A/41	CH ₃ -	CH ₃ -	2-i-C ₃ H ₇ -	H	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
A/42	CH ₃ -	CH ₃ -	2-i-C ₃ H ₇ -	H	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
A/43	CH ₃ -	CH ₃ O-	2-CH ₃	H	O	C ₆ H ₅ CF ₃ (4)-	Op. 164-166
A/44	CH ₃ -	ciklopropil	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ Cl(3)CF ₃ (4)-	Op. 160
A/45	CH ₃ -	ciklopropil	2-i-C ₃ H ₇ -	H	O	C ₆ H ₅ CF ₃ (3)-	Op. 160-163
A/46	CH ₃ -	CH ₃ O-	2-i-C ₃ H ₇ -	H	O	C ₆ H ₅ CF ₃ (4)-	Op. 150-152
A/47	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op. 235-236
A/48	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 178 (bomlik)
A/49	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	5-Cl	O	(2)-piridil-Cl(3)-CF ₃ (5)	Op. 205-206
A/50	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	5-Cl	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 232-233
A/51	CH ₃ -	-CH ₂ -CH=CH ₂	H	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 105-107
A/52	CH ₃ -	ciklopropil	H	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 142-144
A/53	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	5-CF ₃	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,3)-	Op. 253-255
A/54	CH ₃ -	CH ₃ -	2-szekC ₄ H ₉	6-C ₂ H ₅	S	C ₆ H ₅ -	Op. 123-126
A/55	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 171-172
A/56	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,4)-	Op. 223-225
A/57	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	
A/58	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 177-178

Vegy. száma	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	X	R ₃	Fizikai állandók (°C)
A/59	ciklohexil	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	Op. 100-102
A/60	CH ₃ -	CH ₃ -	2-i-C ₃ H ₇	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 143-144
A/61	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 182
A/62	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ (CH ₃) ₂ (2,4)-	Op. 219-220
A/63	CH ₃ O-	CH ₃ O-	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	
A/64	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	3-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
A/65	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
A/66	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	Op. 139-142
A/67	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ CF ₃ (3)Cl(4)-	
A/68	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	Op. 188-189
A/69	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	Op. 197-198
A/70	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 157-158
A/71	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 156-158
A/72	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	Op. 175-176
A/73	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	
A/74	CH ₃ O-	CH ₃ O-	H	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
A/75	CH ₃ -	CH ₃ -	3-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ (CN)(2)CF ₃ (4)-	Op. 239-241
A/76	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ (CN)(2)CF ₃ (4)-	Op. 203-204
A/77	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ (CN)(4)-	
A/78	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	(2)-piridil-Cl(3)CF ₃ (5)	
A/79	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl(3)CF ₃ (5)	Op. 165-166
A/80	CH ₃ -	CH ₃ -	2-i-C ₃ H ₇	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 180-181
A/81	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 191-194
A/82	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op. 234-235
A/83	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl(3)CF ₃ (5)	Op. 171-174
A/84	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 129-130
A/85	CH ₃ O-	CH ₃ O-	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op. 241-243
A/86	CH ₃ O-	CH ₃ O-	H	H	O	(2)-piridil-Cl(3)CF ₃ (5)	Op. 173-176
A/87	CH ₃ -	CH ₃ -	3-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)	Op. 215-216
A/88	CH ₃ O-	CH ₃ -	3-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)	Op. 193-195
A/89	CH ₃ O-	CH ₃ O-	3-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)	
A/90	CH ₃ -	CH ₃ -	3-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op. 216-217
A/91	CH ₃ O-	CH ₃ -	3-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op. 171-172
A/92	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op. 251-253
A.93	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5), N(C ₂ H ₅) ₃ -só	Op.: 100-105
A.94	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5), Ca-só	Op.: 257-260
A.95	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5), Zn-só.H ₂ O	Op.: 282-286
A.96	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5), Al-só.H ₂ O	Op.: 190-195
A.97	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5), Fe ^{III} -só.	Op.: 156-158
A.98	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl(5)-F(3)	Op.: 188-189
A.99	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-CN(3)-CH ₃ (5)- -CF ₃ (6)	Op.: 230-231
A.100	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-CN(3)-CH ₃ (4)- -CF ₃ (6)	Op.: 211-213
A.101	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-CN(2)-CF ₃ (6)	Op.: 238-239
A.102	CH ₃ -	CH ₃ -	3-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl(3)-CH ₃ (5)	Op.: 220-222
A.103	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl(5)-F(3)	Op.: 283-285
A.104	CH ₃ -	C ₂ H ₅ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl(3)-CF ₃ (5)	
A.105	CH ₃ O-	C ₂ H ₅ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	
A.106	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(5)-piridil-CF ₃ (2)	Op.: 180-181
A.107	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl(6)-CF ₃ (4)	Op.: 174-176
A.108	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl(6)CF ₃ (4)	Op.: 165-168
A.109	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (4)	Op.: 167-169
A.110	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (4)	Na-só Op.: 315-320
A.111	CH ₃ -	-CH ₂ -CH=CH ₂	H	H	O	(2)-piridil-Cl(3)CF ₃ (5)	Op.: 119-120
A.112	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil	Op.: 157-158
A.113	CH ₃ -	C ₂ H ₅ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op.: 207-209

Vegy. száma	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	X	R ₃	Fizikai állandók (°C)
A.114	CH ₃ -	-CH ₂ -CH=CH ₂	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op.: 165-168
A.115	CH ₃ -	i-C ₃ H ₇ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op.: 134-136
A.116	CH ₃ -	CH ₃ -	2-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₄ Cl(2)CF ₃ (4)-	
A.117	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-,N(nC ₄ H ₉) ₃ -só	

2. táblázat

(Ib) általános képletű vegyületek

Vegy. száma	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	X	R ₃	Fizikai állandók (°C)
B.1	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,6)-	Op. 262-264
B.2	CH ₃ -	ciklopropil	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 215-217
B.3	CH ₃ -	-CH ₂ CH=CH ₂	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 153-155
B.4	CH ₃ -	ciklohexil	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 142-144
B.5	CH ₃ -	ciklohexil	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 202-203
B.6	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₃ (CH ₃) ₂ (2,4)-	Op. 234-236
B.7	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ CH ₃ (2)-	Op. 228-230
B.8	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₂ Cl ₂ (3,4,5)-	Op. 268-270
B.9	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl ₃ (3)-	Op. 200-202
B.10	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(2)-	Op. 213-215
B.11	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(3)-	Op. 221-222
B.12	ciklopropil	ciklopropil	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 235-238
B.13	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ CH=CH ₂	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 182-185
B.14	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,5)-	Op. 205-207
B.15	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ -t-C ₄ H ₉ (4)	Op. 230-232
B.16	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (3,5)-	Op. 235-237
B.17	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,6)-	Op. 262-264
B.18	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 235-237
B.19	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₃ (CH ₃) ₂ (2,3)-	Op. 226-228
B.20	t-C ₄ H ₉ -	t-C ₄ H ₉ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 140-145
B.21	n-C ₄ H ₉ -	n-C ₄ H ₉ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 172-175
B.22	i-C ₃ H ₇ -	i-C ₃ H ₇ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 180-183
B.23	n-C ₃ H ₇ -	n-C ₃ H ₇ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 179-182
B.24	C ₂ H ₅ -	C ₂ H ₅ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 197-200
B.25	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₄ CH ₃ (3)	Op. 210-212
B.26	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,3)-	Op. 225-227
B.27	CH ₃ -	t-C ₄ H ₉ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 185-187
B.28	CH ₃ -	ciklohexil	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 217-220
B.29	CH ₃ -	-CH ₂ CH=CH ₂	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 183-185
B.30	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,5)-	Op. 238-240
B.31	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₄ F(4)-	Op. >250
B.32	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 199-201
B.33	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ CH ₃ (4)-	Op. 221-223
B.34	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ CH ₃ (2)Cl(4)-	Op. 212-214
B.35	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ -t-C ₄ H ₉ (4)-	Op. 182-184
B.36	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ CH ₃ (4)-	Op. 212-216
B.37	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 221-223
B.38	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 215-217
B.39	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₅ -	Op. 241-243
B.40	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	4-Cl	O	C ₆ H ₃ CH ₃ (4)-	Op. >280
B.41	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	4-Cl	O	C ₆ H ₄ Cl(3)-	Op. 120-122
B.42	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	4-Cl	O	C ₆ H ₅ -	Op. 132-138
B.43	CH ₃ -	CH ₃ -	5-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(2)-	Op. 182-185
B.44	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,3)-	Op. 198-200
B.45	CH ₃ -	i-C ₃ H ₇ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 170-173
B.46	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ F(4)-	Op. 242-244
B.47	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ F(4)-	Op. 220-223
B.48	CH ₃ -	CH ₃ -	5-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 225-230
B.49	CH ₃ -	CH ₃ -	5-Cl	H	O	C ₆ H ₄ CH ₃ (4)-	Op. 200-204

Vegy. száma	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	X	R ₃	Fizikai állandók (°C)
B.50	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 232-236
B.51	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 258-260
B.52	CH ₃ -	CH ₃ -	5-Cl	H	O	C ₆ H ₅ -	Op. 195-198
B.53	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ CH ₃ (4)-	Op. 240-243
B.54	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 215-217
B.55	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₄ -t-C ₆ H ₅ (4)-	Op. 205-207
B.56	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ CN(2)Cl(4)-	Op. 204-206
B.57	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ (CN) ₂ (2,3)-	Op. 253-255
B.58	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	4-Cl	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 270-272
B.59	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 227-228
B.60	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₃ OCH ₃ (3)Cl(4)-	Op. 215-217
B.61	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₃ OCH ₃ (3)Cl(4)-	Op. 230-232
B.62	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Br	H	O	C ₆ H ₃ OCH ₃ (3)Cl(4)-	Op. 225-227
B.63	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₄ CH ₃ (3)-	Op. 200-202
B.64	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)-	Op. 240-241
B.65	ciklohexil	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 217-220
B.66	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 229-230
B.67	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	3-Cl	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 236-237
B.68	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	3-CF ₃	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	Op. 268-270
B.69	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	3-CF ₃	O	C ₆ H ₃ OCH ₃ (3)Cl(4)-	Op. 202
B.70	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	Op. 192-193
B.71	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
B.72	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	Op. 193-194
B.73	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
B.74	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	5-Cl	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
B.75	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	5-Cl	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
B.76	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(4)CF ₃ (3)-	
B.77	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	S	C ₆ H ₃ Cl(4)CF ₃ (3)-	
B.78	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(3)CF ₃ (4)-	
B.79	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	S	C ₆ H ₃ Cl(4)CF ₃ (4)-	
B.80	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	S	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	
B.81	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CH ₃	5-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
B.82	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CH ₃	5-CH ₃	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
B.83	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
B.84	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	6-CH ₃	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (3)-	
B.85	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	6-CH ₃	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	Op. 225-226
B.86	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	6-CH ₃	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
B.87	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	S	C ₆ H ₃ (CN) ₂ (2,3)-	Op. 246-248
B.88	CH ₃ -	CH ₃ -	3-CF ₃	H	O	β-naftil	Op. 233-234
B.89	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	α-naftil	Op. 201-202
B.90	CH ₃ -	CH ₃ -	3-Cl	H	O	β-naftil	Op. 222-223
B.91	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	α-naftil	Op. 190-191
B.92	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	β-naftil	Op. 235-237
B.93	CH ₃ -	CH ₃ -	2-Cl	3-Cl	O	(2)-piridil	Op. 241-242
B.94	CH ₃ O-	CH ₃ -	4-Cl	H	O	C ₆ H ₅ Cl(4)	Op. 228-230
B.95	CH ₃ O-	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₄ Cl ₂ (2,4)-	Op. 222-224
B.96	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	S	C ₆ H ₄ CH ₃ (4)-	Op. 192-193
B.97	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	
B.98	CH ₃ -	C ₂ H ₅ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl(3)-CF ₃ (5)	
B.99	CH ₃ O-	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	C ₆ H ₄ Cl(4)-	

3. Táblázat

(Ic) általános képletű vegyületek

Vegy. száma	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	X	R ₃	Fizikai állandók (°C)
C.1	CH ₃ -	CH ₃ -	2-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 188-189
C.2	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl(3)CF ₃ (4)-	

Vegy. száma	R ₁	R ₂	R ₄	R ₅	X	R ₃	Fizikai állandók (°C)
C.3	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 150
C.4	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 179-180
C.5	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ CN(2)CF ₃ (4)-	Op. 151
C.6	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 130-131
C.7	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	H	O	C ₆ H ₃ CN(2)Cl(4)-	Op. 204-206
C.8	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	S	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	
C.9	CH ₃ -	CH ₃ -	2-CH ₃	6-CH ₃	S	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	
C.10	CH ₃ -	CH ₃ -	H	H	O	(2)-piridil-Cl(3)CF ₃ (5)	
C.11	CH ₃ -	CH ₃ -	4-CH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl(3)CF ₃ (5)	
C.12	CH ₃ O-	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 145-147
C.13	CH ₃ O-	CH ₃ O-	4-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	
C.14	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl(3)CF ₃ (5)	Op. 191-192
C.15	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op. 166-168
C.16	CH ₃ O-	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl ₂ (3,5)	Op. 182-185
C.17	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OC ₂ H ₅	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4)-	Op. 156-157
C.18	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 198-199
C.19	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₄ CF ₃ (4)-	Op. 183-184
C.20	CH ₃ -	CH ₃ -	4-Cl	H	O	(2)-piridil-Cl(3)-CF ₃ (5)	Op. 194-195
C.21	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl(5)-F(3)	Op. 163-164
C.22	CH ₃ O-	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl(3)-CF ₃ (5)	Op. 163-165
C.23	CH ₃ O-	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	Op. 165-167
C.24	CH ₃ -	C ₂ H ₅ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-CF ₃ (5)	
C.25	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	(2)-piridil-Cl(6)CF ₃ (4)	Op. 170-173
C.26	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4), Zn-só.H ₂ O	Op. 275-277
C.27	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ Cl(2)CF ₃ (4), N(C ₂ H ₅) ₃ -só	
C.28	CH ₃ -	CH ₃ -	4-OCH ₃	H	O	C ₆ H ₃ (CN)(2)CF ₃ (4)-	Op. 175-176

2. Formázási példák (%=súlyszázalék)

2.1 Emulgeálható koncentrátumok

	a)	b)	c)
1. táblázat szerinti hatóanyag	25%	40%	50%
Ca-dodecil-benzolszulfonát	5%	8%	6%
ricinusolaj-polietilén-glikol-éter (36 mól etilénoxid)	5%	-	-
tributil-fenol-polietilén-glikol-éter (30 mól etilénoxid)	-	12%	4%
ciklohexanon	-	15%	20%
xilolegy	65%	25%	20%

Ilyen koncentrátumokból vízzel való hígítással minden kívánt töménységű emulzió előállítható.

2.2 Oldatok

	a)	b)	c)	d)
1. táblázat szerinti hatóanyag	80%	10%	5%	95%
etilén-glikol-monometil-éter	20%	-	-	-
polietilén-glikol (mólsúly 400)	-	70%	-	-
N-metil-2-pirrolidon	-	20%	-	-
epoxidált kókuszdióolaj	-	-	1%	5%
benzin (forrástartomány 160-190 °C)	-	-	94%	-

Ezek az oldatok alkalmasak igen kis cseppecskék alakjában történő alkalmazásra.

2.3 Granulátumok	a)	b)
1. táblázat szerinti hatóanyag	5%	10%
kaolin	94%	-
nagy diszperzitású kovasav	1%	-
attapulgit	-	90%

A hatóanyagot metilén-kloridban oldjuk, az oldatot a vivőanyagra rápermetezzük és utána az oldószert vákuumban lepároljuk. Ilyen granulátumokat hozzákeverhetünk az állatok takarmányához.

2.4 Porozó szerek	a)	b)
1. táblázat szerinti hatóanyag	2%	5%
nagy diszperzitású kovasav	1%	5%
talkum	97%	-
kaolin	-	90%

A hatóanyagot bensőleg összekeverjük a vivőanyagokkal és így használatra kész porozó szereket kapunk.

2.5. Vízben diszpergáló porkeverékek	a)	b)	c)
1. táblázat szerinti hatóanyag	25%	50%	75%
Na-ligninszulfonát	5%	5%	-
olajsav	3%	-	5%
Na-diizobutil-naftalinszulfonát	-	6%	10%
oktilfenol-polietilén-glikol-éter (7-8 mól etilénoxid)	-	2%	-
nagy diszperzitású kovasav	5%	10%	10%
kaolin	62%	27%	-

A hatóanyagot az adalékanyagokkal alaposan összekeverjük és megfelelő malomban jól összeőröljük. Ily módon permetezőporokat kapunk, amelyek vízzel minden kívánt töménységű szuszpenzióvá hígíthatók.

2.6 Emulgeálható koncentrátumok	a)	b)	c)
1. táblázat szerinti hatóanyag	10%	8%	60%
oktilfenol-polietilén-glikol-éter (4-5 mól etilénoxid)	3%	3%	2%
ricinusolaj-poliglikoléter (35 mól etilénoxid)	4%	5%	4%
ciklohexanon	30%	40%	15%
xilolelegy	50%	40%	15%
kalcium-dodecil-benzol-szulfonát	3%	4%	4%

Ezekből a koncentrátumokból vízzel való hígítással minden kívánt koncentrációjú emulziót előállíthatunk.

2.7 Porozó szerek	a)	b)
1. táblázat szerinti hatóanyag	5%	8%
talkum	95%	-
kaolin	-	92%

Alkalmazásra kész porozó szereket kapunk oly módon, hogy a hatóanyagot a vivőanyaggal összekeverjük és alkalmas malomban összeőröljük.

2.8 Granulátum	60	
1. táblázat szerinti hatóanyag	10%	A hatóanyagot az adalékanyagokkal összekeverjük, megőröljük és vízzel megnedvesítjük. Az elegyet extrudáljuk és ezt követően levegőáramban szárítjuk.
Na-ligninszulfonát	2%	
karboxi-metilcellulóz	1%	
kaolin	87%	

2.9. Granulátum

1. táblázat szerinti hatóanyag	3%	
polietilénlikol (mólsúly 200)	3%	
kaolin	94%	5

A finomra megőrölt hatóanyagot valamely keverőben polietilénlikollal megnedvesített kaolinra egyenletesen felhordjuk. Ily módon pormentes beágyazott granulátumot kapunk.

2.10. Szuszpendálható koncentrátum

1. táblázat szerinti hatóanyag	40%	15
etilénlikol	10%	
nonilfenol-polietilénlikol-éter (15 mól etilénoxid)	6%	
Na-ligninszulfonát	10%	
karboxi-metilcellulóz	1%	20
37%-os vizes formaldehid-oldat	0.2%	
szilikonolaj 75%-os vizes emulzió alakjában	0.8%	
víz	32%	25

A finomra őrölt hatóanyagot az adalékanyagokkal bensőleg összekeverjük, így szuszpendálható koncentrátumot kapunk, amelyből vízzel való hígítással minden kívánt töménységű szuszpenziót készíthetünk.

2.11. Tabletták, illetve boluszok

I. 1. táblázat szerinti hatóanyag	33.0%	35
metilcellulóz	0.80%	
nagy diszperzitású kovasav	0.80%	
kukoricakeményítő	8.40%	40
II. kristályos tejcukor	22.50%	
kukoricakeményítő	17.00%	
mikrokristályos cellulóz	16.50%	
magnéziumsztearát	1.00%	45
I. A metilcellulózt vízzel elkeverjük és duzzadni hagyjuk; a kovasavat belekeverjük a duzzadt anyagba és homogénen szuszpendáljuk, majd a szuszpenzióba belekeverjük a hatóanyagot és a kukoricakeményítőt. Ebbe a keverékbe beledolgozzuk a vizes szuszpenziót és a kapott anyagot dagasztjuk, majd a keletkező masszát 12 M méretű szitán granuláljuk és szárítjuk.		50
II. Mind a négy segédanyagot jól összekeverjük.		55
III. Az I. és II. fázist összekeverjük és tablettákat vagy boluszokat sajtolunk belőle.		60
3. Biológiai példák		
Az anthelmintikus hatást a következő példák kapcsán mutatjuk be.		65

3.1. Kísérlet nematódákkal, így *Haemonchus contortus*-szal és *Trichostrongylus colubriformis*-szel, fertőzött juhokkal

A hatóanyagot szuszpenzió formájában gyomorszonda segítségével vagy Pansen-injekció alakjában adtuk be olyan juhoknak, amelyek előzőleg *Haemonchus contortus* és *Trichostrongylus colubriformis* nematódákkal mesterségesen megfertőztünk. Kísérletenként, illetve adagonként 1-3 állatot alkalmaztunk. Mindegyik juhot csak egy adaggal kezeltük.

Az első értékelést úgy végeztük, hogy összehasonlítottuk a juhok ürülékében kezelés előtt és után kivált féregpeték számát.

A kezelés után 7-10 nappal a juhokat leöltük és felboncoltuk. Az értékelést úgy végeztük, hogy megállapítottuk a bélben visszamaradt férgek számát. Egyidejűleg és ugyanúgy fertőzött, de kezeletlen juhok szolgáltak kontrollként, illetve összehasonlításként.

Azok a juhok, amelyeket az 1-3. táblázat szerinti hatóanyag szuszpenziójával kezeltünk, a kezeletlen, de fertőzött összehasonlításul szolgáló csoportokhoz viszonyítva 20 mg/kg testsúly adag esetén legalább 90%-al csökkent nematodamegtámadottságot mutattak. Ezen túlmenően a 2.2, 2.3, 2.10, 2.18, 2.29, 2.54, 2.66, 2.72 és 2.91 számú vegyületek 12 mg/kg adagnál, az 1.3, 1.6, 1.9, 1.13, 1.47, 2.36 és 3.4 számú vegyületek 5 mg/kg adagnál 95%-os és az 1.43, 1.46 és 1.48 számú vegyületek 2,5 mg/kg adagnál 100%-os hatáserősítést biztosítottak a kezelésnél.

3.2 Kísérlet *Fasciola hepatica*-val fertőzött juhokkal

A hatóanyagot szuszpenzió formájában gyomorszonda segítségével vagy Pansen-injekció alakjában adtuk be olyan juhoknak, amelyeket előzőleg *Fasciola hepatica*-val mesterségesen megfertőztünk. Kísérletenként, illetve adagonként 3 állatot alkalmaztunk. Mindegyik állatot csak egyetlen egy adaggal kezeltük.

Az első értékelést úgy végeztük, hogy összehasonlítottuk a juhok ürülékében kezelés előtt és után kivált féregpeték számát.

A kezelés után 3-4 héttel a juhokat leöltük és felboncoltuk. Az értékelést úgy végeztük, hogy megállapítottuk a kezelés után az epejáratokban visszamaradt májmételyféreg számát. Egyidejűleg és ugyanúgy fertőzött, de kezeletlen juhok szolgáltak kontrollként, illetve összehasonlításként. A két csoportnál meghatározott májmételyféreg száma közötti különbség adja a vizsgált hatóanyag hatáserősítőképességét.

Ennél a kísérletnél az 1. táblázat szerinti 1.46 számú vegyület 12 mg/kg testsúly adag esetén legalább 90%-os hatást mutatott *Fasciola hepatica* ellen.

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Eljárás (I) általános képletű 5-fenil-karbamoil-barbitursav-származékok, tautomerjeik és sóik előállítására, e képletben

R_1 és R_2 egymástól függetlenül 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxicsopori, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport vagy allilcsoport;

R_3 helyettesítetlen naftil-, fenil- vagy piridilcsoport vagy egyszerűen benzilcsoporttal, vagy egyszerűen, kétszeresen vagy háromszorosan halogénatommal, cianocsoporttal, 1-5 szénatomos alkilcsoporttal, trihalogén-metil-csoporttal, dihalogén-metoxi-csoporttal vagy 1-5 szénatomos alkoxi-csoporttal helyettesített fenil- vagy piridilcsoport;

R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, trihalogén-metil-csoport, 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-5 szénatomos alkoxicsopori vagy 1-5 szénatomos alkil-tio-csoport, és

X jelentése oxigén- vagy kénatom, azzal a megszorítással, hogy

- R_1 jelentése 1-3 szénatomos alkoxicsopori, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport vagy allilcsoport, akkor, ha R_2 valamely 1-5 szénatomos alkilcsoport, R_3 trihalogén-metil-csoporttal egyszerűen, kétszeresen vagy háromszorosan helyettesített fenilcsoport, továbbá R_4 és R_5 szubsztituensek mindegyike egyidejűleg hidrogénatom, halogénatom vagy trihalogén-metil-csoport, és

- R_1 jelentése 1-3 szénatomos alkoxicsopori, vagy 4-6 szénatomos cikloalkilcsoport akkor, ha R_2 valamely 1-5 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport vagy ciklopropilcsoport, míg R_4 és R_5 az aminocsoporthoz viszonyítva 2-es és 6-os helyzetben állóan egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1-5 szénatomos alkilcsoport, mimellett -X- R_3 jelentése 4-(4-trifluor-metil-fenoxi)-csoport, azzal jellemezve, hogy

a) 50-250 °C hőmérsékleten valamely (II) általános képletű észtert egy (III) általános képletű anilinszármazékkal reagáltatunk, e képletben R 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy adott esetben nitrocsoporttal helyettesített fenilcsoport, míg R_1 - R_5 és X jelentése a fenti, vagy

b) 0-220 °C hőmérsékleten valamely (IV) általános képletű helyettesített barbitursavat egy (V) általános képletű helyettesített fenil-izocianáttal reagáltatunk, e képletben R_1 - R_5 és X jelentése a fenti, vagy

c) 50-250 °C hőmérsékleten valamely (IV) általános képletű helyettesített barbitursavat egy (VI) általános képletű helyettesített benzoiil-aziddal reagáltatunk, e képletben R_1 - R_5 és X jelentése a fenti, és

kívánt esetben az a), b) vagy c) eljárás-

sal kapott szabad savat ismert módon sójává alakítjuk.

2. Az 1. igénypont szerinti a), b) vagy c) eljárás olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil-, allil- vagy ciklopropilcsoport; R_3 fenil-, piridilcsoport vagy egyszerűen vagy kétszeresen halogénatommal, cianocsoporttal, trihalogén-metil-csoporttal vagy 1-5 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített fenil- vagy piridilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy trihalogén-metil-csoport és X jelentése oxigén- vagy kénatom, azzal jellemezve, hogy megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

3. Az 1. igénypont szerinti a), b) vagy c) eljárás olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxicsopori; R_3 helyettesítetlen fenilcsoport vagy helyettesítetlen piridilcsoport vagy egyszerűen vagy kétszeresen halogénatommal, trihalogén-metil-csoporttal vagy 1-5 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített fenil- vagy piridilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-5 szénatomos alkoxicsopori, halogénatom vagy trihalogén-metil-csoport és X oxigén- vagy kénatom, azzal jellemezve, hogy megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

4. Az 1. igénypont szerinti a), b) vagy c) eljárás olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxicsopori; R_3 metilcsoporttal, klóratommal vagy trifluor-metil-csoporttal helyettesített fenilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-3 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxicsopori vagy klóratom és X oxigénatom, azzal jellemezve, hogy megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

5. Az 1. igénypont szerinti a), b) vagy c) eljárás olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxicsopori; R_3 metilcsoporttal, klóratommal vagy trifluor-metil-csoporttal helyettesített piridilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-3 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxicsopori vagy klóratom és X oxigénatom, azzal jellemezve, hogy megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

6. Az 1. igénypont szerinti a), b) vagy c) eljárás 1,3-dimetil-5-[4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursav előállítására, azzal jellemezve, hogy megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

7. Az 1. igénypont szerinti a), b) vagy c) eljárás 1,3-dimetil-5-[3-(2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi)-4-metoxi-fenil-karbamoil]-barbitursav előállítására, azzal jellemezve, hogy megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazunk.

8. Az 1. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy az a), b) vagy c) eljárásokat valamely, a reakcióval szemben közömbös oldó- vagy hígítószer jelenlétében vitelezzük ki.

9. Az 1. vagy 8. igénypontok szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy az a) vagy c) eljárást 100-220 °C hőmérsékleten vagy a b) eljárást 0-200 °C hőmérsékleten hajtjuk végre.

10. A 8. vagy 9. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy az a), b) vagy c) eljárást valamely bázis jelenlétében vitelezzük ki.

11. Eljárás hatóanyagként legalább egy (I) általános képletű, 5-fenil-karbamoil-barbitursav-származékot, tautomerjét vagy sóját - e képletben R_1 - R_5 és X jelentése az 1. igénypontban megadott - tartalmazó anthelmintikus készítmény előállítására, azzal jellemezve, hogy az 1. igénypont szerinti bármely eljárással előállított hatóanyagot egy vagy több hordozó- és/vagy egyéb segédanyaggal keverjük össze, és a keveréket ismert módon anthelmintikus készítménnyé alakítjuk.

12. A 11. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű vegyületet alkalmazunk, amelyben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil-, allil vagy ciklopropilcsoport; R_3 fenil-, piridilcsoport vagy egyszeresen vagy kétszeresen halogénatommal, cianocsoporttal, trihalogén-metil-csoporttal vagy 1-5 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített fenil- vagy piridilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy trihalogén-metil-csoport és X jelentése oxigén- vagy kénatom.

13. A 11. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) ál-

talános képletű vegyületet alkalmazunk, amelyben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxicsoport; R_3 helyettesítetlen fenil- vagy piridilcsoport vagy egyszeresen vagy kétszeresen halogénatommal, trihalogén-metil-csoporttal vagy 1-5 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített fenil- vagy piridilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-5 szénatomos alkilcsoport, 1-5 szénatomos alkoxicsoport, halogénatom vagy trihalogén-metil-csoport és X oxigén- vagy kénatom.

14. A 11. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű vegyületet alkalmazunk, amelyben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxicsoport; R_3 metilcsoporttal, klóratommal vagy trifluor-metil-csoporttal helyettesített fenilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-3 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxicsoport vagy klóratom és X oxigénatom.

15. A 11. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű vegyületet alkalmazunk, amelyben R_1 és R_2 egymástól függetlenül metil- vagy metoxicsoport; R_3 metilcsoporttal, klóratommal vagy trifluor-metil-csoporttal helyettesített piridilcsoport; R_4 és R_5 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-3 szénatomos alkilcsoport, 1-3 szénatomos alkoxicsoport vagy klóratom és X oxigénatom.

16. A 11. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként 1,3-dimetil-5-[4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenil-karbamoil]-barbitursavat alkalmazunk.

17. A 11. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként 1,3-dimetil-5-[3-(2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi)-4-metoxi-fenil-karbamoil]-barbitursavat alkalmazunk.

3 db rajz

A kiadásért felel a Közgazdasági és Jogi Könyvkiadó igazgatója

88.572.66-4 Alföldi Nyomda Debrecen - Felelős vezető: Benkő István vezérigazgató

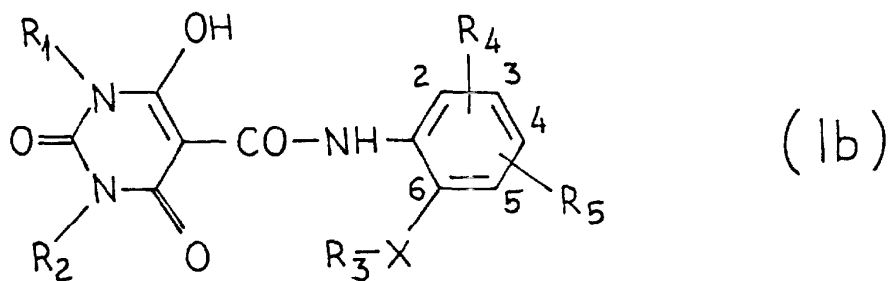
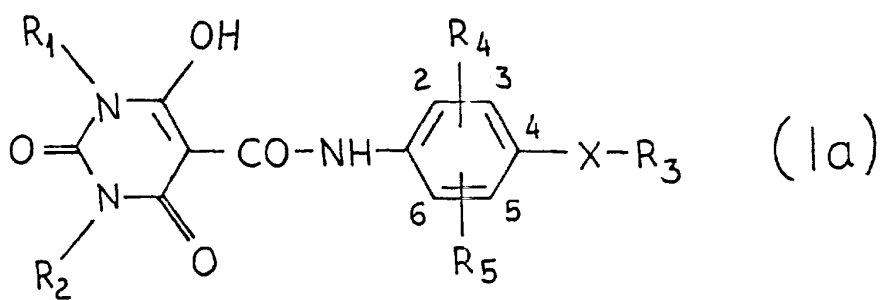
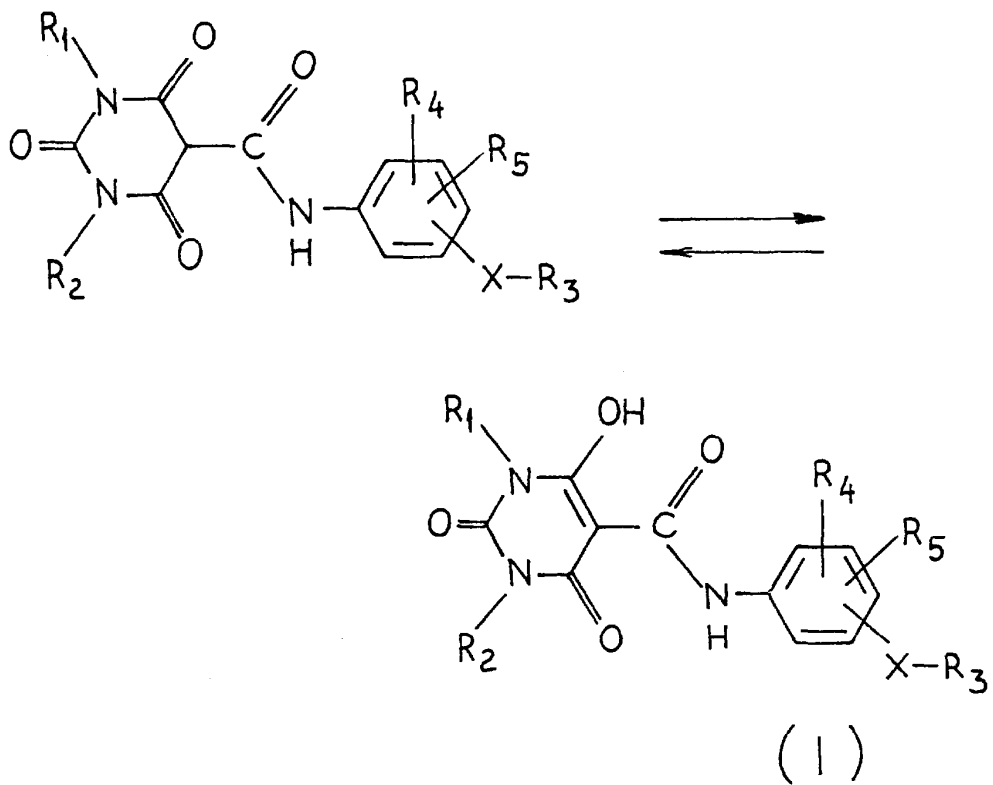
192991

Nemzetközi osztályozás:

C 07 D 239/62

C 07 D 401/12

A 61 K 31/515



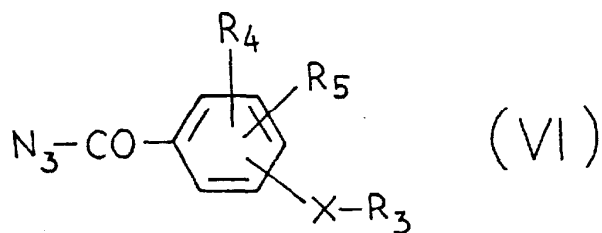
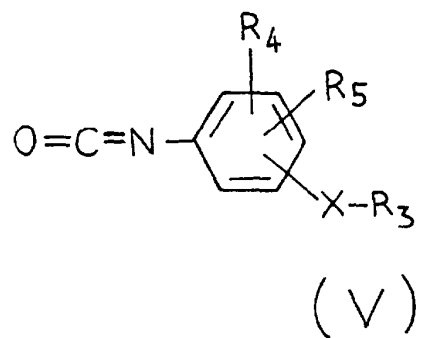
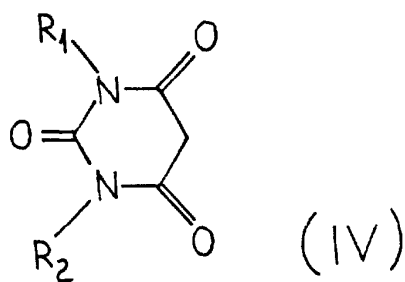
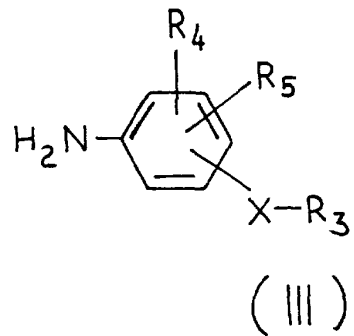
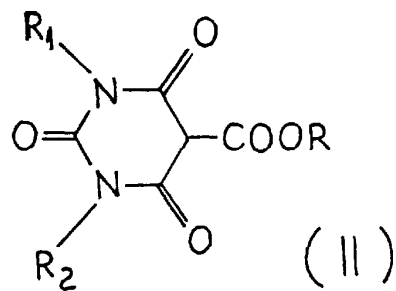
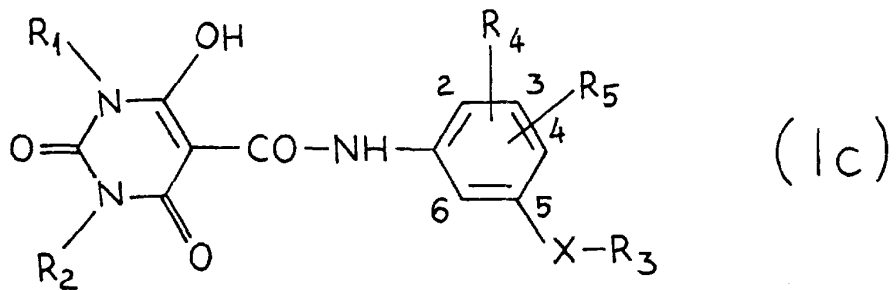
192991

Nemzetközi osztályozás:

C 07 D 239/62

C 07 D 401/12

A 61 K 31/515



192991
Nemzetközi osztályozás:
C 07 D 239/62
C 07 D 401/12
A 61 K 31/515

